

translation

41-6-5

PCT COOPERATION TREATY

PCT/JP2003/008478



PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70) Rec'd PCT/PTO 29 DEC 2004

Applicant's or agent's file reference 1496	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/JP2003/008478	International filing date (day/month/year) 03 July 2003 (03.07.2003)	Priority date (day/month/year) 03 July 2002 (03.07.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 317/72, A61K 31/357, A61P 1/04, 3/10, 9/02, 9/04, 9/10, 11/02, 11/06, 13/12, 17/02, 17/06, 25/24, 25/28, 29/00, 31/18, 37/02, 37/08, 43/00, C07C 51/377, 65/21, 65/03		
Applicant KYOWA HAKKO KOGYO CO., LTD.		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.

2. This REPORT consists of a total of 6 sheets, including this cover sheet.

☐ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).

These annexes consist of a total of _____ sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:

- I ☒ Basis of the report
- II ☐ Priority
- III ☐ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- IV ☒ Lack of unity of invention
- V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- VI ☐ Certain documents cited
- VII ☐ Certain defects in the international application
- VIII ☐ Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 25 December 2003 (25.12.2003)	Date of completion of this report 02 July 2004 (02.07.2004)
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

Form PCT/IPEA/409 (cover sheet) (July 1998)

BEST AVAILABLE COPY

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International Application No.

PCT/JP2003/008478

I. Basis of the report

1. With regard to the elements of the international application:*

- ☒ the international application as originally filed
- ☐ the description:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the claims:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, as amended (together with any statement under Article 19
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the drawings:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the sequence listing part of the description:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____

2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.

These elements were available or furnished to this Authority in the following language _____ which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
- ☐ the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☐ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/fig _____

5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).**

* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

** Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International Application No.

PCT/JP2003/008478

IV. Lack of unity of invention

1. In response to the invitation to restrict or pay additional fees the applicant has:

- ☐ restricted the claims.
☐ paid additional fees.
☐ paid additional fees under protest.
☒ neither restricted nor paid additional fees.

2. ☐ This Authority found that the requirement of unity of invention is not complied with and chose, according to Rule 68.1, not to invite the applicant to restrict or pay additional fees.

3. This Authority considers that the requirement of unity of invention in accordance with Rules 13.1, 13.2 and 13.3 is

- ☐ complied with.
☒ not complied with for the following reasons:

See supplemental sheet

4. Consequently, the following parts of the international application were the subject of international preliminary examination in establishing this report:

- ☐ all parts.
☒ the parts relating to claims Nos. 1-8

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP 03/08478

Supplemental Box

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: IV. 3.

The claims set forth the following two groups of inventions.

(1) The inventions set forth in claims 1-8, of a process for producing compounds represented by formula (VII) from a compound represented by formula (V).

(2) The inventions set forth in claims 9-11, of a process for producing compounds represented by formula (II) from a compound represented by formula (I).

The inventions in (1) and the inventions in (2) above do not have a common technical feature, and cannot be said to constitute a group of inventions so linked as to form a single general inventive concept.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International Application No.
PCT/JP 03/08478

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

Novelty (N)	Claims	1, 6-8	YES
	Claims	2-5	NO
Inventive step (IS)	Claims	1, 6-8	YES
	Claims	2-5	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-8	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanations

The following document is cited in the international search report.

Document 1: EP 0771794 A1

Document 1 discloses a process for producing 1,3-benzodioxole-4-(aromatic substituted)methyl-2-spiro-cycloalkanes by reacting a (1,3-benzodioxole-2-spiro-cycloalkane)-4-carboxylic acid ester with a methyl-substituted aromatic compound. Therefore, the novelty and inventive step of the production processes claimed in claims 2-5, as stipulated in PCT Article 33(2) and (3), are taken away by the disclosure in document 1.

However, document 1 does not disclose a production process claimed in claims 1 and 6-8, which is a process for producing 1,3-benzodioxole-2-spirocycloalkane derivatives which includes a step wherein a 2,3-dihydroxy-benzoic acid derivative is reacted with a cycloalkene derivative. Moreover, by adopting an aforementioned step, the process for producing 1,3-benzodioxole-2-spiro-cycloalkane derivatives as set forth in claims 1 and 6-8 offers the marked advantageous effect that isolation and purification of the intermediates is easy, since it does

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International Application No.

PCT/JP 03/08478

not involve intermediates which are oils and are difficult to handle, and this advantage is not obvious to a person skilled in the art, even when general knowledge of the art is considered. Therefore, process for producing 1,3-benzodioxole-2-spirocycloalkane derivatives as set forth in claims 1 and 6-8 is novel and involves an inventive step as stipulated in PCT Article 33(2) and (3).

REC'D 29 JUL 2004

WIPO

PCT

国際予備審査報告

(法第12条、法施行規則第56条)
[PCT36条及びPCT規則70]

出願人又は代理人 の書類記号 1496	今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知(様式PCT/ IPEA/416)を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JPO3/08478	国際出願日 (日.月.年) 03.07.2003	優先日 (日.月.年) 03.07.2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl. ¹ C07D317/72, A61K31/357, A61P1/04, 3/10, 9/02, 9/04, 9/10, 11/02, 13/12, 17/02, 17/06, 25/24, 25/28, 29/00, 31/18, 37/02, 37/08, 43/00, C07C51/377, 65/21, 65/03		
出願人 (氏名又は名称) 協和醗酵工業株式会社		

1. 国際予備審査機関が作成したこの国際予備審査報告を法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。	
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で <u>4</u> ページからなる。 <input type="checkbox"/> この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関に対してした訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面も添付されている。 (PCT規則70.16及びPCT実施細則第607号参照) この附属書類は、全部で <u> </u> ページである。	
3. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。	
I	<input checked="" type="checkbox"/> 国際予備審査報告の基礎
II	<input type="checkbox"/> 優先権
III	<input type="checkbox"/> 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
IV	<input checked="" type="checkbox"/> 発明の単一性の欠如
V	<input checked="" type="checkbox"/> PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
VI	<input type="checkbox"/> ある種の引用文献
VII	<input type="checkbox"/> 国際出願の不備
VIII	<input type="checkbox"/> 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 25.12.2003	国際予備審査報告を作成した日 02.07.2004	
名称及びあて先 日本特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 田名部 拓也	4P 9738
電話番号 03-3581-1101 内線 3492		

I. 国際予備審査報告の基礎

1. この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に
 応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。
 PCT規則70.16, 70.17)

☒ 出願時の国際出願書類

- ☐ 明細書 第 _____ ページ、出願時に提出されたもの
☐ 明細書 第 _____ ページ、国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
☐ 明細書 第 _____ ページ、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの

- ☐ 請求の範囲 第 _____ 項、出願時に提出されたもの
☐ 請求の範囲 第 _____ 項、PCT19条の規定に基づき補正されたもの
☐ 請求の範囲 第 _____ 項、国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
☐ 請求の範囲 第 _____ 項、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの

- ☐ 図面 第 _____ ページ/図、出願時に提出されたもの
☐ 図面 第 _____ ページ/図、国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
☐ 図面 第 _____ ページ/図、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの

- ☐ 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、出願時に提出されたもの
☐ 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
☐ 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの

2. 上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である _____ 語である。

- ☐ 国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)にいう翻訳文の言語
☐ PCT規則48.3(b)にいう国際公開の言語
☐ 国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語

3. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。

- ☐ この国際出願に含まれる書面による配列表
☐ この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された書面による配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった
☐ 書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記載した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4. 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 図面の第 _____ ページ/図

5. ☐ この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c) この補正を含む差し替え用紙は上記1.における判断の際に考慮しなければならず、本報告に添付する。)

IV. 発明の単一性の欠如

1. 請求の範囲の減縮又は追加手数料の納付の求めに対して、出願人は、

- ☐ 請求の範囲を減縮した。
- ☐ 追加手数料を納付した。
- ☐ 追加手数料の納付と共に異議を申立てた。
- ☒ 請求の範囲の減縮も、追加手数料の納付もしなかった。

2. ☐ 国際予備審査機関は、次の理由により発明の単一性の要件を満たしていないと判断したが、PCT規則68.1の規定に従い、請求の範囲の減縮及び追加手数料の納付を出願人に求めないこととした。

3. 国際予備審査機関は、PCT規則13.1、13.2及び13.3に規定する発明の単一性を次のように判断する。

- ☐ 満足する。
- ☒ 以下の理由により満足しない。

請求の範囲には、次の2つの発明が記載されている。

- (1) 請求の範囲1-8に記載された式(V)の化合物から(VII)で表される化合物を製造する方法の発明
- (2) 請求の範囲9-11に記載された式(I)の化合物から(II)で表される化合物を製造する方法の発明

上記(1)の発明と(2)の発明とは、共通の技術的特徴を有さず、単一の一般的発明概念を形成するように連関する一群の発明であるとはいえない。

4. したがって、この国際予備審査報告書を作成するに際して、国際出願の次の部分を、国際予備審査の対象にした。

- ☐ すべての部分
- ☒ 請求の範囲 1-8 に関する部分

V. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT,35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性(N)

請求の範囲 1, 6-8

有

請求の範囲 2-5

無

進歩性(IS)

請求の範囲 1, 6-8

有

請求の範囲 2-5

無

産業上の利用可能性(IA)

請求の範囲 1-8

有

請求の範囲

無

2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

国際調査報告には、以下の文献が示されている。

文献1/EP 0771794 A1

文献1には、(1, 3-ベンゾジオキソール-2-スピロシクロアルカン)-4-カルボン酸のエステルを、メチル置換芳香族化合物と反応させて、1, 3-ベンゾジオキソール-4-芳香環置換メチル-2-スピロシクロアルカンを製造する方法が記載されている。したがって、請求の範囲2-5に記載された製造方法は、文献1の記載により、PCT第33条(2)および(3)に規定する新規性および進歩性を否定される。

一方、請求の範囲1、6-8に記載された製造方法のように、1, 3-ベンゾジオキソール-2-スピロシクロアルカン誘導体の製造方法であって、2, 3-ジヒドロキシ安息香酸誘導体をシクロアルケン誘導体と反応させる工程を含む方法は、文献1に記載されていない。また、請求の範囲1、6-8に記載された1, 3-ベンゾジオキソール-2-スピロシクロアルカン誘導体の製造方法は、上記工程を採用したことにより、油状で扱いにくい中間体を経由しないので、中間体の単離・精製が容易であるという顕著な効果を奏するものであって、このことは、技術常識を考慮しても当業者に自明ではない。したがって、請求の範囲1、6-8に記載された1, 3-ベンゾジオキソール-2-スピロシクロアルカン誘導体の製造方法は、PCT第33条(2)および(3)に規定する新規性および進歩性を有する。

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ **BLACK BORDERS**
- ☐ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☐ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☐ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☐ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☒ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☐ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☐ **OTHER:** _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.